

特 許 協 力 条 約

PCT

特許性に関する国際予備報告 (特許協力条約第二章)

REC'D 02 SEP 2004

WIPO

PCT

〔PCT 36条及びPCT規則70〕

出願人又は代理人 の書類記号 1503	今後の手続きについては、様式PCT/IPEA/416を参照すること。	
国際出願番号 PCT/IB03/03475	国際出願日 (日.月.年) 22.08.2003	優先日 (日.月.年) 22.08.2002
国際特許分類 (IPC) Int. Cl ⁷ A61K45/00, 31/519, 31/55, 31/7088, 39/395, 48/00, A61P17/04, 43/00, C07D401/14, 403/06, 417/14, 471/14, 519/00		
出願人 (氏名又は名称) 協 和 醗 酵 工 業 株 式 会 社		

1. この報告書は、PCT 35条に基づきこの国際予備審査機関で作成された国際予備審査報告である。 PCT 36条の規定に従い送付する。	
2. この国際予備審査報告は、この表紙を含めて全部で 7 ページからなる。	
3. この報告には次の附属物件も添付されている。 a <input type="checkbox"/> 附属書類は全部で _____ ページである。 <input type="checkbox"/> 補正されて、この報告の基礎とされた及び/又はこの国際予備審査機関が認めた訂正を含む明細書、請求の範囲及び/又は図面の用紙 (PCT規則70.16及び実施細則第607号参照) <input type="checkbox"/> 第I欄4. 及び補充欄に示したように、出願時における国際出願の開示の範囲を超えた補正を含むものとこの国際予備審査機関が認定した差替え用紙 b <input checked="" type="checkbox"/> 電子媒体は全部で フレキシブルディスク 1枚 である (電子媒体の種類、数を示す)。 配列表に関する補充欄に示すように、コンピュータ読み取り可能な形式による配列表又は配列表に関連するテーブルを含む。 (実施細則第802号参照)	
4. この国際予備審査報告は、次の内容を含む。 <input checked="" type="checkbox"/> 第I欄 国際予備審査報告の基礎 <input type="checkbox"/> 第II欄 優先権 <input checked="" type="checkbox"/> 第III欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての国際予備審査報告の不作成 <input checked="" type="checkbox"/> 第IV欄 発明の単一性の欠如 <input checked="" type="checkbox"/> 第V欄 PCT 35条(2)に規定する新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解、それを裏付けるための文献及び説明 <input type="checkbox"/> 第VI欄 ある種の引用文献 <input type="checkbox"/> 第VII欄 国際出願の不備 <input type="checkbox"/> 第VIII欄 国際出願に対する意見	

国際予備審査の請求書を受理した日 19.03.2004	国際予備審査報告を作成した日 11.08.2004	
名称及びあて先 日本国特許庁 (IPEA/JP) 郵便番号100-8915 東京都千代田区霞が関三丁目4番3号	特許庁審査官 (権限のある職員) 荒 木 英 則	4C 9736
電話番号 03-3581-1101 内線 3450		

様式PCT/IPEA/409 (表紙) (2004年1月)

第I欄 報告の基礎

1. この国際予備審査報告は、下記に示す場合を除くほか、国際出願の言語を基礎とした。

☐ この報告は、_____語による翻訳文を基礎とした。

それは、次の目的で提出された翻訳文の言語である。

☐ PCT規則12.3及び23.1(b)にいう国際調査

☐ PCT規則12.4にいう国際公開

☐ PCT規則55.2又は55.3にいう国際予備審査

2. この報告は下記の出願書類を基礎とした。(PCT14条の規定に基づく命令に応答するために提出された差替え用紙は、この報告において「出願時」とし、この報告に添付していない。)

☒ 出願時の国際出願書類

☐ 明細書

第 _____ ページ、
第 _____ ページ*、
第 _____ ページ*、

出願時に提出されたもの

付けて国際予備審査機関が受理したもの

付けて国際予備審査機関が受理したもの

☐ 請求の範囲

第 _____ 項、
第 _____ 項*、
第 _____ 項*、
第 _____ 項*、

出願時に提出されたもの

PCT19条の規定に基づき補正されたもの

付けて国際予備審査機関が受理したもの

付けて国際予備審査機関が受理したもの

☐ 図面

第 _____ ページ/図、
第 _____ ページ/図*、
第 _____ ページ/図*、

出願時に提出されたもの

付けて国際予備審査機関が受理したもの

付けて国際予備審査機関が受理したもの

☒ 配列表又は関連するテーブル

配列表に関する補充欄を参照すること。

3. ☐ 補正により、下記の書類が削除された。

☐ 明細書 第 _____ ページ
☐ 請求の範囲 第 _____ 項
☐ 図面 第 _____ ページ/図
☐ 配列表 (具体的に記載すること) _____
☐ 配列表に関連するテーブル (具体的に記載すること) _____

4. ☐ この報告は、補充欄に示したように、この報告に添付されかつ以下に示した補正が出願時における開示の範囲を越えてされたものと認められるので、その補正がされなかったものとして作成した。(PCT規則70.2(c))

☐ 明細書 第 _____ ページ
☐ 請求の範囲 第 _____ 項
☐ 図面 第 _____ ページ/図
☐ 配列表 (具体的に記載すること) _____
☐ 配列表に関連するテーブル (具体的に記載すること) _____

* 4. に該当する場合、その用紙に "superseded" と記入されることがある。

第三欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解の不作成

1. 次に、当該請求の範囲に記載されている発明の新規性、進歩性又は産業上の利用可能性につき、次の理由により審査しない。

- ☐ 国際出願全体
- ☒ 請求の範囲 13, 17-19

理由：

- [X] この国際出願又は請求の範囲 13, 17-19 は、国際予備審査をすることを要しない
次の事項を内容としている（具体的に記載すること）。

請求の範囲13、17-19に係る発明は治療による人体の処置方法に関するものである。(PCT34条(4)(a)(i)、PCT規則67.1(iv))

- ☐ 明細書、請求の範囲若しくは図面（次に示す部分）又は請求の範囲 _____ の記載が、不明確であるため、見解を示すことができない（具体的に記載すること）。

- ☐ 全部の請求の範囲又は請求の範囲 _____ が、明細書による十分な裏付けを欠くため、見解を示すことができない。

- ☒ 請求の範囲 13, 17-19 について、国際調査報告が作成されていない。

- ☐ スクレオチド又はアミノ酸の配列表が、実施細則の附属書C（塩基配列又はアミノ酸配列を含む明細書等の作成のためのガイドライン）に定める基準を、次の点で満たしていない。

- | | | |
|------------------------|--------------------------|----------------|
| 書面による配列表が | <input type="checkbox"/> | 提出されていない。 |
| | <input type="checkbox"/> | 所定の基準を満たしていない。 |
| コンピュータ読み取り可能な形式による配列表が | <input type="checkbox"/> | 提出されていない。 |
| | <input type="checkbox"/> | 所定の基準を満たしていない。 |

- ☐ コンピュータ読み取り可能な形式によるヌクレオチド又はアミノ酸の配列表に関連するテーブルが、実施細則の附属書Cの2に定める技術的な要件を、次の点で満たしていない。

- ☐ 提出されていない。
☐ 所定の技術的な要件を満たしていない。

- ☐ 詳細については補充欄を参照すること。

第IV欄 発明の単一性の欠如

1. 請求の範囲の減縮又は追加手数料の納付の求めに対して、出願人は、

- ☐ 請求の範囲を減縮した。
- ☒ 追加手数料を納付した。
- ☐ 追加手数料の納付と共に異議を申立てた。
- ☐ 請求の範囲の減縮も、追加手数料の納付もしなかった。

2. ☐ 国際予備審査機関は、次の理由により発明の単一性の要件を満たしていないと判断したが、PCT規則68.1の規定に従い、請求の範囲の減縮及び追加手数料の納付を出願人に求めないこととした。

3. 国際予備審査機関は、PCT規則13.1、13.2及び13.3に規定する発明の単一性を次のように判断する。

- ☐ 満足する。
- ☒ 以下の理由により満足しない。

請求の範囲1-3、12、15および16のうち1-3を引用する部分、並びに20-22に係る発明に共通の技術的事項は、配列番号11記載のアミノ酸配列を有する蛋白質のシグナル伝達に関する機能を抑制する物質を有効成分として含有して掻痒を予防および／または治療することにあるものと認められる。一方、請求の範囲4-11、14、並びに、15および16のうち10を引用する部分に係る発明に共通の技術的事項は、式(I)で表される化合物自体にあるものと認められる。

してみれば、両者に共通する、特別の技術的特徴となり得る技術的事項は存在せず、両者が単一の一般的発明概念を形成するように連関したものであるということとはできない。

なお、請求の範囲13、17-19に係る発明は、国際調査報告が作成されていないものである。そのため、上記発明としては記載しなかった。

4. したがって、国際出願の次の部分について、この報告を作成した。

☒ すべての部分

☐ 請求の範囲 _____ に関する部分

第V欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についてのPCT35条(2)に定める見解、
裏付ける文献及び説明

それを

1. 見解

新規性 (N)	請求の範囲	1-12, 14-16, 20-22	有
	請求の範囲		無
進歩性 (IS)	請求の範囲	4-11, 14	有
	請求の範囲	1-3, 12, 15, 16, 20-22	無
産業上の利用可能性 (IA)	請求の範囲	1-12, 14-16, 20-22	有
	請求の範囲		無

2. 文献及び説明 (PCT規則70.7)

見解は、国際調査報告において引用された以下の文献1から8、及び、本見解において新たに引用する以下の文献9及び10の記載に基づいて示された。

文献1 : WO 02/24222 A2 (THE CLEVELAND CLINIC FOUNDATION)

文献2 : BEERS, M. H., *et al.* (ed.) THE MERCK MANUAL OF DIAGNOSIS AND THERAPY. 17th Edition. 1999, ISBN 0911910-10-7, ISSN 0076-6526, pp. 786-793

文献3 : WO 02/061087 A2 (LIFESPAN BIOSCIENCES, INC.)

文献4 : HEIBER, M., *et al.* DNA Cell Biol., 1995, 14(1), pp. 25-35

文献5 : MAHADEVAN, M. S., *et al.* Genomics, 1995, 30, pp. 84-88

文献6 : EP 549352 A2 (KYOWA HAKKO KOGYO CO., LTD.)

文献7 : EP 325755 A1 (KYOWA HAKKO KOGYO CO., LTD.)

文献8 : JP 9-40662 A (協和醗酵工業株式会社)

文献9 : JP 2001-324495 A (小林製薬株式会社)

文献10 : 久保 道徳ら, 薬学雑誌, 1997, 117(4), pp. 193-201

○請求の範囲1-3, 12, 15, 16, 20-22について

文献1には、有効量のGPR4のアンタゴニストを投与することによりアトピー性皮膚炎の処置に有効であること、及びSPCがアトピー性皮膚炎に関与し増悪させることが知られている。ここで、請求の範囲1-3, 12, 15, 16及び20-22に係る発明と文献1に記載されたものとを比較すると、前者では適応疾患が掻痒とされるのに対し、後者はアトピー性皮膚炎である点、前者では抗体が認識するアミノ酸配列のように具体的なアンタゴニストが限定されているのに対し、後者では限定されていないものがある点、及び、前者では治療剤のスクリーニング方法として動物を用いたものが記載されているのに対し、後者では培養細胞を用いた系が記載されている点で相違する。

しかし、文献2にもあるように、アトピー性皮膚炎の代表的症状として掻痒のあることは当業者にとり周知の事項であるから、アトピー性皮膚炎に有効であるとされるGPR4のアンタゴニストを掻痒の処置に用いることに、当業者が格別の創意を要したとは認められない。

(続葉に続く。)

配列表に関する補充欄

第 I 欄 2. の続き

1. この国際出願で開示されかつ請求の範囲に係る発明に必要なヌクレオチド又はアミノ酸配列に関して、以下に基づき国際予備報告を作成した。

- a. タイプ ☐ 配列表
☒ 配列表に関連するテーブル
- b. フォーマット ☐ 書面
☒ コンピュータ読み取り可能な形式
- c. 提出時期 ☐ 出願時の国際出願に含まれる
☒ この国際出願と共にコンピュータ読み取り可能な形式により提出された
☐ 出願後に、調査又は予備審査のために、この国際機関に提出された
☐ _____ 付けて、この国際予備審査機関が補正*として受理した

2. ☐ さらに、配列表又は配列表に関連するテーブルを提出した場合に、出願後に提出した配列若しくは追加して提出した配列が出願時に提出した配列と同一である旨、又は、出願時の開示を超える事項を含まない旨の陳述書の提出があった。

3. 補足意見：

*第 I 欄 4. に該当する場合、差替える配列表又は配列表に関連するテーブルに "superseded" と記入されることがある。

補充欄

いずれかの欄の大きさが足りない場合

第 V. 欄の続き

また、具体的なアンタゴニストの限定の点に関しても、GPR4の全アミノ酸配列が特定されており、これに対するアンタゴニストとして抗体等が選択可能であることが文献3から5にもあるように公知であるから、これらを選択することは当業者が必要に応じて適宜なし得る程度の事項であるに過ぎない。

更に、アトピー性皮膚炎の増悪に寄与するSPCは掻痒の増悪にも寄与するものであることが当業者が当然に認識する事項であるところ、掻痒の処置に有用な成分のスクリーニング方法として、掻破行動を引き起こす物質を動物に皮下投与や皮内投与する工程、試験化合物を動物に皮下投与や皮内投与する工程、掻破行動の回数を測定する工程、試験化合物投与の有無による掻破行動回数の差を比較する工程、及び、掻破行動の回数を減少させる物質を選択する工程は文献9及び10にあるように公知である。してみれば、具体的な掻痒治療剤のスクリーニング方法として、文献9や10にある方法において、掻破行動を引き起こす物質にSPCを用いてみることに、当業者が格別の創意を要したものとはいふことができない。

したがって、請求の範囲1-3, 12, 15, 16及び20-22に係る発明は、文献1から5, 9及び10の記載から進歩性を有さない。

○請求の範囲4-11, 14について

文献6から8には、それぞれ医薬として有用な三環系化合物が記載されている。

しかしながら、これらの化合物はいずれもこれらの請求の範囲に記載される化合物とはその化学構造を異にするものであって、その具体的用途に共通のものがなく、かつ、GPR4との関係は特に知られていない。してみれば、これらの文献の記載によっては、当業者といえども容易にこれらの請求の範囲に係る発明に想到し得たものとはいふことができない。

したがって、請求の範囲4-11及び14に係る発明は、文献1から10の記載によっても、進歩性を有するものである。